

no Engl. Equiv

BR

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
27. Oktober 2005 (27.10.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
WO 2005/100352 A1

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: C07D 471/04,  
235/26, 249/12, 495/04, 401/14, 487/08, 471/08, 451/04,  
519/00, A61K 31/437, 31/4184, 31/4196, 31/519, 31/551,  
A61P 25/06

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2005/003759

(22) Internationales Anmeldedatum:  
9. April 2005 (09.04.2005)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
10 2004 018 796.7 15. April 2004 (15.04.2004) DE

(71) Anmelder (nur für AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,  
BE, BF, BG, BJ, BR, BW, BY, BZ, CA, CF, CG, CH, CI, CM,  
CN, CO, CR, CU, CY, CZ, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,  
FI, FR, GA, GB, GD, GE, GH, GM, GN, GQ, GR, GW, HR,  
HU, ID, IE, IL, IN, IS, IT, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK,  
LR, LS, LT, LU, LV, MA, MC, MD, MG, MK, ML, MN, MR,  
MW, MX, MZ, NA, NE, NI, NL, NO, NZ, OM, PG, PH, PL,  
PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SI, SK): BOEHRINGER  
INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH [DE/DE];  
Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim/Rhein (DE).

(71) Anmelder: BOEHRINGER INGELHEIM PHARMA  
GMBH & CO. KG [DE/DE]; Binger Strasse 173, 55216  
Ingelheim Am Rhein (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): RUDOLF, Klaus  
[DE/DE]; Oeschweg 11, 88447 Warthausen (DE).  
MUELLER, Stephan Georg [DE/DE]; Maelzerstrasse  
13, 88447 Warthausen (DE). LUSTENBERGER, Philipp  
[CH/DE]; Maelzerstrasse 8, 88447 Warthausen (DE).

STENKAMP, Dirk [DE/DE]; Bonifaz-Locher-Weg 8,  
88400 Biberach (DE). SCHAEENZLE, Gerhard [DE/DE];  
Sophie von La Roche Weg 10, 88400 Biberach-Mettenberg  
(DE). ARNDT, Kirsten [DE/DE]; Vorarlberger Strasse  
51, 88400 Biberach (DE). DOODS, Henri [NL/DE];  
Freiherr-von-Koenig-Str. 6, 88447 Warthausen (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: BOEHRINGER INGEL-  
HEIM INTERNATIONAL GMBH; Binger Strasse 173,  
55216 Ingelheim/Rhein (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für  
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,  
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,  
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,  
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,  
KG, KM, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA,  
MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM,  
PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY,  
TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU,  
ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für  
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,  
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG,  
ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU,  
TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,  
EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL,  
PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI,  
CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

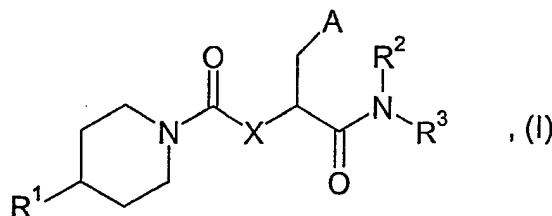
Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht  
— vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden  
Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen  
eintreffen

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: SELECTED CGRP-ANTAGONISTS, THEIR PREPARATION PROCESSES AND THEIR USE AS MEDICAMENTS

(54) Bezeichnung: AUSGEWÄHLTE CGRP-ANTAGONISTEN, VERFAHREN ZU DEREN HERSTELLUNG SOWIE DEREN  
VERWENDUNG ALS ARZNEIMITTEL



(57) Abstract: CGRP-antagonists are disclosed having the gen-  
eral formula (I), in which A, X and R<sup>1</sup>-R<sup>3</sup> have the definition  
given in claim 1, as well as their tautomers, diastereomers, enan-  
tiomers, hydrates, mixtures and salts, as well as their salt hy-  
drates, in particular their physiologically compatible salts with  
inorganic or organic acids, medicaments containing these com-  
pounds, their use and their preparation processes.

(57) Zusammenfassung: Gegenstand der vorliegenden Erfin-  
dung sind die CGRP-Antagonisten der allgemeinen Formel (I) in der A, X und R<sup>1</sup> bis R<sup>3</sup> wie in Anspruch 1 definiert sind, deren  
Tautomere, deren Diastereomere, deren Enantiomere, deren Hydrate, deren Gemische und deren Salze sowie die Hydrate der Salze,  
insbesondere deren physiologisch verträgliche Salze mit anorganischen oder organischen Säuren, diese Verbindungen enthaltende  
Arzneimittel, deren Verwendung und Verfahren zu ihrer Herstellung.

WO 2005/100352 A1